

14 JUN 2005

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
24. Juni 2004 (24.06.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer

WO 2004/052852 A1

not Sk

(51) Internationale Patentklassifikation²: C07D 207/34, A61K 31/40, 31/402, 31/4025, C07D 401/06, 401/12, 403/06, 403/12, 405/12, 413/06, 405/06

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER HEALTHCARE AG [DE/DE]; 51368 Leverkusen (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/013278

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ZIMMERMANN, Holger [DE/DE]; Katernberger Schulweg 53, 42113 Wuppertal (DE). BRÜCKNER, David [DE/DE]; Fischerstr. 15, 45128 Essen (DE). HEIMBACH, Dirk [DE/DE]; An der Kaiserburg 13, 40629 Düsseldorf (DE). HENNINGER, Kerstin [DE/DE]; Claudiusweg 7, 42115 Wuppertal (DE). HEWLETT, Guy [GB/DE]; Krutscheider Weg 96, 42327 Wuppertal (DE). ROSEN-TRETER, Ulrich [DE/DE]; Obere Rutenbeck 6, 42349 Wuppertal (DE). SCHOHE-LOOP, Rudolf [DE/DE]; Arndtstr. 10 a, 42327 Wuppertal (DE). BAUMEISTER,

(22) Internationales Anmeldedatum:
26. November 2003 (26.11.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

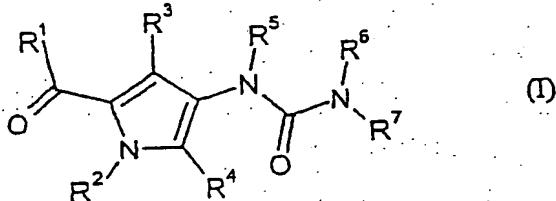
(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 57 358.1 9. Dezember 2002 (09.12.2002) DE

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 3-PYRROLYL UREA DERIVATIVES AND THEIR USE AS ANTVIRAL AGENTS

(54) Bezeichnung: 3-PYRROLYL-HARNSTOFF-DERIVATE UND IHRE VERWENDUNG ALS ANTVIRALE MITTEL



and a 5- to 10-membered heteroaryl and whereby R² as an aryl can be substituted with 0, 1, 2 or 3 substituents R²⁻² independently of one another, selected from the group comprising halogen, hydroxy, C₁-C₆ alkoxy, hydroxycarbonyl, C₁-C₆ alkoxy carbonyl, C₁-C₆ alkylcarbonyloxy, amino, C₁-C₆ alkylamino, aminocarbonyl, C₁-C₆ alkylaminocarbonyl, C₃-C₈ cycloalkyl, a 5- to 10-membered heterocycl, C₆-C₁₀ aryl and a 5- to 10-membered heteroaryl; R³ and R⁴ independently of one another represent hydrogen or C₁-C₆ alkyl; R⁵ and R⁶ independently of one another represent hydrogen or C₁-C₆ alkyl; and R⁷ represents a 3- to 12-membered carbocycl, whereby the carbocycl can be substituted with 0, 1, 2, 3, 4 or 5 substituents independently of one another, selected from the group comprising halogen, hydroxy, C₁-C₆ alkyl and C₁-C₆ alkoxy. The invention also relates to a method for producing said pyrroles, to their use for the treatment and/or prophylaxis of diseases, in addition to their use for producing medicaments for the treatment and/or prophylaxis of diseases, notably to their use as antiviral agents, in particular against cytomegalovirus.

(57) **Abstract:** The invention relates to substituted pyrroles of formula (I), in which: R¹ represents -OR⁸ or -NR⁹R¹⁰, R² represents hydrogen, C₁-C₆ alkyl or aryl, whereby R² as an alkyl can be substituted with 0, 1, 2 or 3 substituents R²⁻¹ independently of one another, selected from the group comprising halogen, hydroxy, C₁-C₆ alkoxy, hydroxycarbonyl, C₁-C₆ alkoxy carbonyl, C₁-C₆ alkylcarbonyloxy, amino, C₁-C₆ alkylamino, aminocarbonyl, C₁-C₆ alkylaminocarbonyl, C₃-C₈ cycloalkyl, a 5- to 10-membered heterocycl, C₆-C₁₀ aryl and a 5- to 10-membered heteroaryl; R³ and R⁴ independently of one another represent hydrogen or C₁-C₆ alkyl; and R⁵ and R⁶ independently of one another represent hydrogen or C₁-C₆ alkyl; and R⁷ represents a 3- to 12-membered carbocycl, whereby the carbocycl can be substituted with 0, 1, 2, 3, 4 or 5 substituents independently of one another, selected from the group comprising halogen, hydroxy, C₁-C₆ alkyl and C₁-C₆ alkoxy. The invention also relates to a method for producing said pyrroles, to their use for the treatment and/or prophylaxis of diseases, in addition to their use for producing medicaments for the treatment and/or prophylaxis of diseases, notably to their use as antiviral agents, in particular against cytomegalovirus.

(57) **Zusammenfassung:** Die Erfindung betrifft substituierte Pyrrole der Formel (I), in welcher R¹ für -OR⁸ oder -NR⁹R¹⁰ steht, R² für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder Aryl steht, wobei R² gleich Alkyl substituiert sein kann mit 0, 1, 2 oder 3 Substituenten R²⁻¹ unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Halogen, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy, Hydroxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyloxy, Amino, C₁-C₆-Alkylamino, Aminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, 5- bis 10-gliedriges Heterocycl, C₆-C₁₀-Aryl, Phenoxy und 5- bis 10-gliedriges Heteroaryl, wobei R² gleich Aryl substituiert sein kann mit 0, 1, 2 oder 3 Substituenten R²⁻² unabhängig voneinander ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Halogen, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl und C₁-C₆-Alkoxy. Die Erfindung auch zu einem Verfahren für die Herstellung von Pyrrolen, zu deren Verwendung zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Krankheiten, insbesondere zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Cytomegaloviren.

WO 2004/052852 A1

36 492



Judith [DE/DE]; Kreuzstr. 46, 42277 Wuppertal (DE). SCHMIDT, Thorsten [DE/DE]; Gartenstr. 187, 60596 Frankfurt (DE). REEFSCHLÄGER, Jürgen [DE/DE]; Nedderlandsweg 45, 26125 Oldenburg (DE). LANG, Dieter [DE/DE]; Wimmersbergerstr. 60, 42553 Velbert (DE). LIN, Tse-I. [CN/DE]; Elisabethstr. 5, 42287 Wuppertal (DE). RADTKE, Martin [DE/DE]; Am Mergelsberg 36, 40699 Erkrath (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER HEALTHCARE AG; Law and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht
— vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zwei- und Dreibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.